

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
30. September 2004 (30.09.2004)

PCT

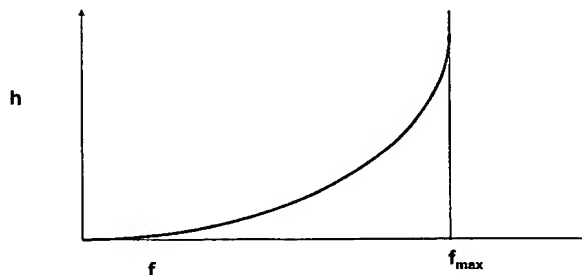
(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/082666 A3

- (51) Internationale Patentklassifikation⁷: A61K 9/51 (72) Erfinder; und
(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/001589 (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): DAHMS, Gerd
[DE/DE]; Koopmannstr. 59 a, 47138 Duisburg (DE).
(22) Internationales Anmeldedatum: 19. Februar 2004 (19.02.2004) SEIDEL, Holger [DE/DE]; Im Hort 43, 47055 Duisburg
(DE).
(25) Einreichungssprache: Deutsch (74) Anwälte: ISENBRUCK, Günter usw.; Isenbruck, Bösl,
Hörschler, Wichmann, Huhn Theodor-Heuss-Anlage 12,
(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch 68165 Mannheim (DE).
(30) Angaben zur Priorität: 103 12 763.1 21. März 2003 (21.03.2003) DE (81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: MSSN DISPERSION AND METHOD FOR PRODUCING THE SAME

(54) Bezeichnung: MSSN-DISPERSION UND VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG



(57) Abstract: The invention relates to membrane-structured solid nanoparticles that have an average particle diameter ranging from 10 to 10000 nm, that are solid at 25 °C and that comprise a combination of active substance carrier particles and emulsifiers in such a manner that membranes penetrating the entire nanoparticles are formed so that emulsifiers are present in the interior and on the surface of the nanoparticles. The invention also relates to a method for producing an aqueous substance carrying dispersion in which solid active substance carrier particles on a wax, polymer or lipid basis having an average diameter ranging from 10 to 10000 nm are present. Said particles contain at least one pharmaceutical, cosmetic and/or food technological active substance. The dispersion is produced by a) mixing, at a temperature above the melting or softening point of the active substance carrier, the active substance comprising the active substance carrier on a wax, polymer or lipid basis with at least one emulsifier that leads in step b) to the formation of a lyotropic liquid-crystalline mixed phase and forming a phase B, b) mechanically mixing, at a temperature above the melting or softening point of the active substance carrier, phase B with an aqueous phase A that may contain an emulsifier, the weight ratio of phase B to phase A being 1:5 to 5:1, without using high-pressure homogenization, and forming a lyotropic liquid-crystalline mixed phase, c) diluting, to a desired final concentration of the dispersion, the mixed phase with an aqueous phase that may contain an emulsifier, at a temperature of the aqueous phase that is below the melting or softening point of the active substance carrier while stirring and without using high-pressure homogenization.

(57) Zusammenfassung: Membran-strukturierte Solid-Nanoparticles mit einem mittleren Teilchendurchmesser im Bereich von 10 bis 10.000 nm, die bei 25 °C fest sind und eine Kombination aus Wirkstoffträgerteilchen und Emulgatoren derart aufweisen, dass Membranen gebildet werden, die die gesamten Nanoparticles durchdringen, so dass im Inneren und an der Oberfläche der Nanoparticles Emulgatoren vorliegen, werden beschrieben.

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

WO 2004/082666 A3



MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

- (84) **Bestimmungsstaaten** (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht
- vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eintreffen

- (88) **Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts:**

12. Mai 2005

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

Die Herstellung einer wässrigen Stoffträger-Dispersion, in der feste Wirkstoffträgerpartikel auf Wachs-, Polymer- oder Lipidbasis mit einem mittleren Durchmesser im Bereich von 10 bis 10000 nm vorliegen, die mindestens einen pharmazeutischen, kosmetischen und/oder lebensmitteltechnologischen Wirkstoff enthalten, erfolgt durch a) Vermischen des Wirkstoffs mit dem Wirkstoffträger auf Wachs-, Polymer- oder Lipidbasis und mindestens einem Emulgator, der in Stufe b) zur Ausbildung einer lyotropen flüssigkristallinen Mischphase führt, bei einer Temperatur oberhalb des Schmelz- oder Erweichungspunktes des Wirkstoffträgers, zur Ausbildung einer Phase B; b) mechanisches Vermischen der Phase B mit einer wässrigen Phase A, die einen Emulgator enthalten kann, bei einer Temperatur oberhalb des Schmelz- oder Erweichungspunktes des Wirkstoffträgers, wobei das Gewichtsverhältnis von Phase B zu Phase A 1 : 5 bis 5 : 1 beträgt, ohne Hochdruckhomogenisierung, zur Ausbildung einer lyotropen flüssigkristallinen Mischphase; c) Verdünnen der Mischphase mit einer wässrigen Phase, die einen Emulgator enthalten kann, bei einer Temperatur der wässrigen Phase, die unter dem Schmelz- oder Erweichungspunkt des Wirkstoffträgers liegt, unter Rühren und ohne Hochdruckhomogenisierung, auf eine gewünschte Endkonzentration der Dispersion.